

**PCT**  
WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM  
Internationales Büro  
INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)



22

<p>(51) Internationale Patentklassifikation <sup>7</sup> : <b>A61K 9/12, C09K 3/30</b></p>	<p><b>A1</b></p>	<p>(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: <b>WO 00/06121</b></p> <p>(43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 10. Februar 2000 (10.02.00)</p>
<p>(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/CH99/00337</p> <p>(22) Internationales Anmeldedatum: 22. Juli 1999 (22.07.99)</p> <p>(30) Prioritätsdaten: 1565/98                      24. Juli 1998 (24.07.98)                      CH</p> <p>(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): JAGO RE- SEARCH AG [CH/CH]; Seestrasse 91, CH-6052 Hergiswil (CH).</p> <p>(72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): KELLER, Manfred [DE/DE]; Hegegasse 7, D-79189 Bad Krozingen (DE). HERZOG, Kurt [CH/CH]; Burgfelderstrasse 204, CH-4055 Basel (CH). MÜLLER-WALZ, Rudi [DE/DE]; Hans-Velter-Strasse 108, D-79650 Schopfheim (DE). KRAUS, Holger [CH/CH]; Hauptstrasse 12c, CH-4462 Rickenbach (CH).</p> <p>(74) Anwalt: A. BRAUN BRAUN HERITIER ESCHMANN AG; Holbeinstrasse 36-38, CH-4051 Basel (CH).</p>		<p>(81) Bestimmungsstaaten: AU, CA, CN, IN, JP, NO, NZ, US, ZA, europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).</p> <p><b>Veröffentlicht</b> <i>Mit internationalem Recherchenbericht.</i></p>

(54) Title: MEDICINAL AEROSOL FORMULATIONS

(54) Bezeichnung: MEDIZINISCHE AEROSOLFORMULIERUNGEN

(57) Abstract

The invention relates to a compression-fluidized propellant mixture for aerosols, containing dinitrogen monoxide and a hydrofluoroalkane with between 1 and 3 carbon atoms, especially 1,1,1,2-tetrafluoroethane and/or 1,1,1,2,3,3,3-heptafluoropropane, which improves the wetting properties for pharmaceutical active ingredients so that the difficulties associated with the use of hydrofluoroalkanes in the preparation of suspension and solution aerosols can be overcome and improved medicinal aerosol formulations can be obtained as a result. Using dinitrogen monoxide it is also possible to influence pressure and thus particle size distribution in a targeted manner and to improve the stability at storage of oxidation-sensitive active ingredients by displacement of oxygen out of the hydrofluoroalkanes. If desired the propellant mixture can also contain carbon dioxide.

(57) Zusammenfassung

Ein druckverflüssigtes Treibmittelgemisch für Aerosole, umfassend Distickstoffmonoxid und ein Hydrofluoralkan mit 1 bis 3 Kohlenstoffatomen, insbesondere 1,1,1,2-Tetrafluorethan und/oder 1,1,1,2,3,3,3-Heptafluorpropan, ermöglicht eine Verbesserung der Benetzungseigenschaften für pharmazeutische Wirkstoffe, womit man die mit Hydrofluoralkanen bestehenden Formulierungsprobleme in Bezug auf Suspensions- als auch Lösungsaerosole überwinden und damit verbesserte medizinische Aerosolformulierungen erhalten kann. Mit Hilfe von Distickstoffmonoxid ist es auch möglich, den Druck und damit die Teilchengrößenverteilung gezielt zu beeinflussen sowie durch Verdrängung von Sauerstoff aus den Hydrofluoralkanen die Lagerstabilität von oxidationsempfindlichen Wirkstoffen zu verbessern. Gewünschtenfalls kann das Treibmittelgemisch zusätzlich Kohlendioxid enthalten.